

## 1,1,2-triph nylbut-1- n derivatives

Patent Number:  US5047431

Publication date: 1991-09-10

Inventor(s): SCHICKANEDER HELMUT (DE); LOESER ROLAND (DE); GRILL HELMUT (DE)

Applicant(s): KLINGE CO CHEM PHARM FAB (DE)

Requested Patent:  EP0054168, B1

Application Number: US19900523266 19900514

Priority Number(s): DE19803046719 19801211

IPC Classification: A61K31/135; C07C217/20

EC Classification: C07C45/46, C07C45/67C, C07C45/68, C07C49/84, C07D309/12

Equivalents:  DE3046719,  IE51882, JP1320416C, JP57122049, JP60039347B, MX9203724

### Abstract

Novel (E)-1-[4'-(2-alkylaminoethoxy)phenyl]-1- (3'-hydroxyphenyl)-2-phenylbut-1-enes of the general formula

wherein R1 and R2 may be the same or different, provided that, when R1 and R2 are the same, each of them is a methyl or ethyl radical, and when R1 and R2 are different, one of them is hydrogen and the other is a methyl or ethyl radical, and the therapeutically compatible salts thereof, have a marked anti-estrogenic effect and are suitable for treating hormone-dependent mammary tumors. The compounds can

be prepared by dehydrating carbinols of the general formula  wherein R1 and R2 may be the same or different, provided that, when R1 and R2 are the same, each of them is a methyl or ethyl radical, and when R1 and R2 are different, one of them is a benzyl radical and the other is a methyl or ethyl radical; and wherein R3 is hydrogen or an easily hydrolyzable protecting group, through the action of mineral acid while removing any protecting group present, isolating through crystallization the E-form from the pair of isomers obtained, and removing by hydrogenolysis any benzyl group present. Compositions comprising the subject 1,1,2-triphenylbut-1-ene derivatives are described also. The corresponding novel 1,1,2-triphenylbut-1-ene derivatives having the (Z) configuration are also disclosed.

Data supplied from the esp@cenet database - I2



Europäisches Patentamt  
European Patent Office  
Office européen des brevets

(11) Veröffentlichungsnummer: **0 054 168**  
**B1**

(12)

## EUROPÄISCHE PATENTSCHRIFT

- (45) Veröffentlichungstag der Patentschrift:  
**11.07.84**
- (51) Int. Cl.<sup>3</sup>: **C 07 C 93/06, A 61 K 31/135**
- (21) Anmeldenummer: **81109254.3**
- (22) Anmeldetag: **29.10.81**

---

(54) 1,1,2-Triphenyl-but-1-en-Derivate sowie Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Arzneimittel.

---

(30) Priorität: <b>11.12.80 DE 3046719</b>	(73) Patentinhaber: <b>Klinge Pharma GmbH, Berg-am-Laim-Strasse 129, D-8000 München 80 (DE)</b>
(43) Veröffentlichungstag der Anmeldung: <b>23.06.82 Patentblatt 82/25</b>	(72) Erfinder: <b>Schickaneder, Helmut, Dr., Anzinger Strasse 22, D-8011 Poing (DE)</b> Erfinder: <b>Löser, Roland, Dr., Fichtenweg 12, D-8133 Feldafing (DE)</b> Erfinder: <b>Grill, Helmut, Dr., Zugspitzstrasse 148, D-8011 Vaterstetten (DE)</b>
(45) Bekanntmachung des Hinweises auf die Patenterteilung: <b>11.07.84 Patentblatt 84/28</b>	(74) Vertreter: <b>Wuesthoff, Franz, Dr.-Ing. et al, Patentanwälte Wuesthoff -v. Pechmann-Behrens-Goetz Schweigerstrasse 2, D-8000 München 90 (DE)</b>
(84) Benannte Vertragsstaaten: <b>AT BE CH DE FR GB IT LI LU NL SE</b>	
(56) Entgegenhaltungen: <b>DE - A - 1 493 282</b>	

EP 0 054 168 B1

---

Anmerkung: Innerhalb von neun Monaten nach der Bekanntmachung des Hinweises auf die Erteilung des europäischen Patents im Europäischen Patentblatt kann jedermann beim Europäischen Patentamt gegen das erteilte europäische Patent Einspruch einlegen. Der Einspruch ist schriftlich einzureichen und zu begründen. Er gilt erst als eingereicht, wenn die Einspruchsgebühr entrichtet worden ist (Art. 99(1) Europäisches Patentübereinkommen).

---